

**Полтавський державний медичний університет
Кафедра фармакології, клінічної фармакології та фармації**

**ПСИХОМОТОРНІ СТИМУЛЯТОРИ.
АНТИДЕПРЕСАНТИ. НООТРОПНІ
ЛІКАРСЬКІ ЗАСОБИ. АДАПТОГЕНИ.
АНАЛЕПТИКИ**

ЗМІСТ

1. Основні групи засобів, що стимулюють ЦНС
2. Фармакологія психомоторних стимуляторів
3. Фармакологічні властивості антидепресантів
4. Характеристика ноотропних засобів
5. Властивості і застосування адаптогенів
6. Аналептики як ліки для невідкладної допомоги
7. Використання стимуляторів ЦНС в стоматології та їх побічні ефекти в порожнині рота
8. Контрольні завдання

ЗАСОБИ, ЩО СТИМУЛЮЮТЬ ЦНС

Психомоторні стимулятори

Антидепресанти

Ноотропи

Адаптогени

Аналептики

ПСИХОМОТОРНІ СТИМУЛЯТОРИ: визначення та класифікація

Психомоторні стимулятори - це препарати, що стимулюють переважно кору головного мозку. Вони підвищують розумову та фізичну працездатність.

КЛАСИФІКАЦІЯ

А. Пуринергічні засоби

1. Метилксантини: Кофеїн, Теофілін

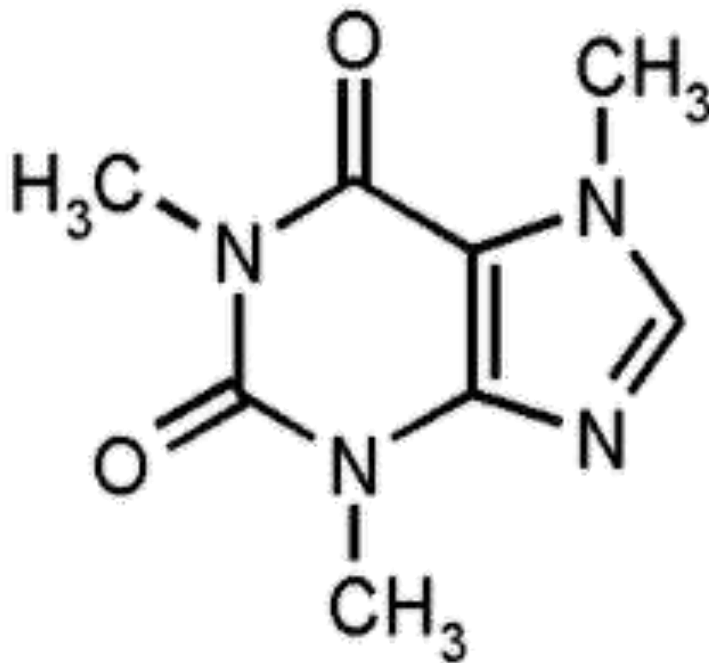
Б. Адренергічні засоби

1. Фенілалкилами́ни: Амфетамін (Фенамін)

2. Похідні піперидину: Мерідил

3. Похідні сидноіміну: Мезокарб (Сиднокарб).

ПУРИНЕРГІЧНІ ПСИХОМОТОРНІ СТИМУЛЯТОРИ: Кофеїн



Кофеїн – похідне метилксантину. Солі кофеїну (цитрат, бензоат) краще розчинні у воді і частіше використовуються в медицині.

РОСЛИНИ, ЩО МІСТЯТЬ КОФЕЇН:

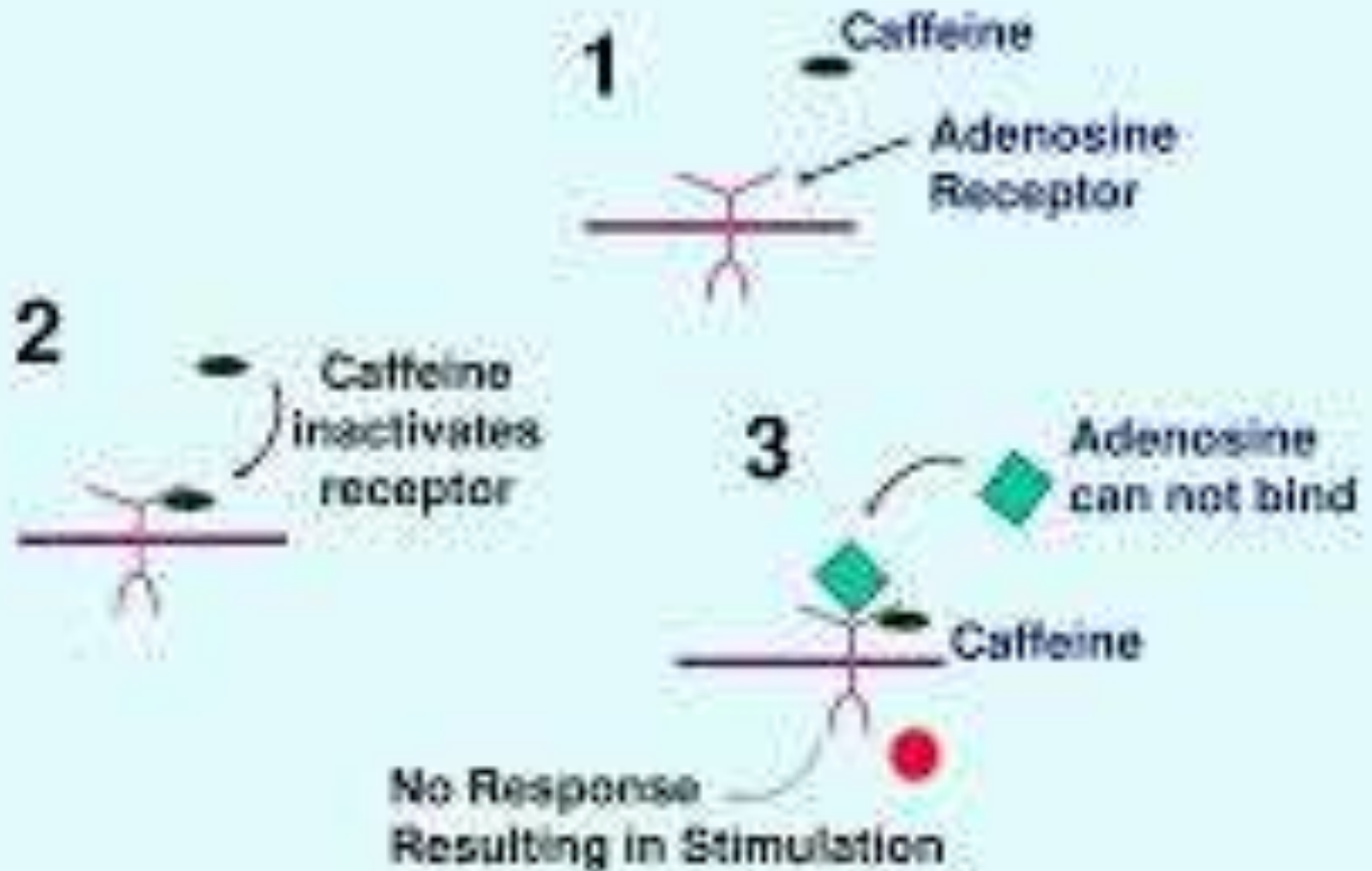
Coffe arabica (ліворуч), *Thea chinensis* (праворуч)



КОФЕЇН: фармакокінетика

- вводитьься всередину, п/шк, в/м, в/в
- добре всмоктується в ШКТ
- проникає в ЦНС і крізь плаценту
- метаболізується в печінці
- виводиться із сечею та молоком матері
- діє протягом 4 год; $T_{1/2} = 3,9 - 5,3$ год, повністю виводиться протягом 24 год.

КОФЕЇН: неселективний антагоніст аденозинорецепторів



КОФЕЇН: механізм дії

- блокує всі підтипи аденозинових рецепторів і зменшує їх гальмівний вплив на ЦНС
- стимулює транслокацію позаклітинного кальцію в клітини
- пригнічує фосфодіестеразу і підвищує концентрацію цАМФ в клітинах
- підвищує активність фосфорилази, що призводить до посилення метаболізму глікогену та утворення енергії.

КОФЕЇН: фармакодинаміка

- **Психостимулююча дія** (посилення процесів збудження в корі головного мозку; зменшення часу відгуку на подразники; підвищення розумової та рухової активності; зниження стомлюваності та сонливості)
- **Аналептична дія** (пряма стимуляція дихального і вазомоторного центрів)
- **Стимуляція рефлекторної діяльності спинного мозку**
- **Зміни частоти серцевих скорочень**, які залежать від співвідношення між прямим і непрямим впливом на серце внаслідок подразнення центру *n. vagus* (як правило, збільшення частоти серцевих скорочень)
- **Дія на кровоносні судини**, яка є сумою центральної дії (вазоконстрикція) та периферичної дії (розширення судин): розширюються кровоносні судини серця, легенів, нирок, скелетних м'язів; кровоносні судини в мозкових оболонках спочатку розширюються, потім – звужуються (що призводить до зменшення головного болю)
- **Підвищення АТ** (у деяких осіб – зниження АТ або без змін)
- **Посилення дихання**
- **Стимуляція шлункової секреції**
- **Діуретична дія.**

КОФЕЇН: показання

- Зниження розумової та фізичної працездатності
- Астенічний синдром
- Втома, сонливість
- Артеріальна гіпотензія, колапс
- Інфекції та інші захворювання з пригніченням дихання і серцево-судинної діяльності
- Бронхолегенева дисплазія у недоношених дітей (профілактика, лікування)
- Діагностика секреторної функції шлунка
- Спазми судин головного мозку, головний біль (як інгредієнт комбінованих препаратів).



КОФЕЇН: побічна дія та протипоказання

Побічна дія

1. Дратівливість, занепокоєння
2. Безсоння
3. Головний біль
4. Тахікардія, аритмія
5. Гіпертензія
6. Біль у животі
7. Дегідратація
8. Легка лікарська залежність
9. Синдром відміни (млявість, дратівливість, головний біль в осіб, які споживали більше 600 мг кофеїну на добу).

Протипоказання

1. Психомоторне збудження
2. Артеріальна гіпертензія
3. Аритмія
4. Атеросклероз
5. Гіпертиреоз
6. Гастрит, виразка шлунка



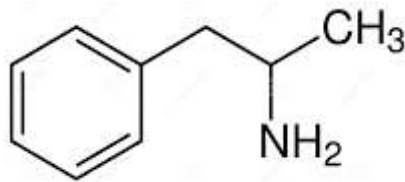
КОФЕЇН: цікаві факти

- Кофеїн є найпоширенішою у світі психоактивною речовиною
- Кофеїн цитрат входить у список основних лікарських засобів ВООЗ
- Кофеїн може викликати легку форму наркозалежності, пов'язану з симптомами відміни
- Чашка кави містить 80–175 мг кофеїну, залежно від того, яке зерно використовується
- Кофеїн класифікується як безпечна речовина. Токсичні дози (понад 10 г на добу для дорослої людини) набагато вищі, ніж терапевтична доза, менша 500 мг на добу.
- Додавання кофеїну до парацетамолу або ібупрофену помірно збільшує частку осіб, які досягають послаблення болю.
- Вживання кофеїну після абдомінальної операції скорочує час до відновлення нормальної функції кишечника і скорочує тривалість перебування в стаціонарі.

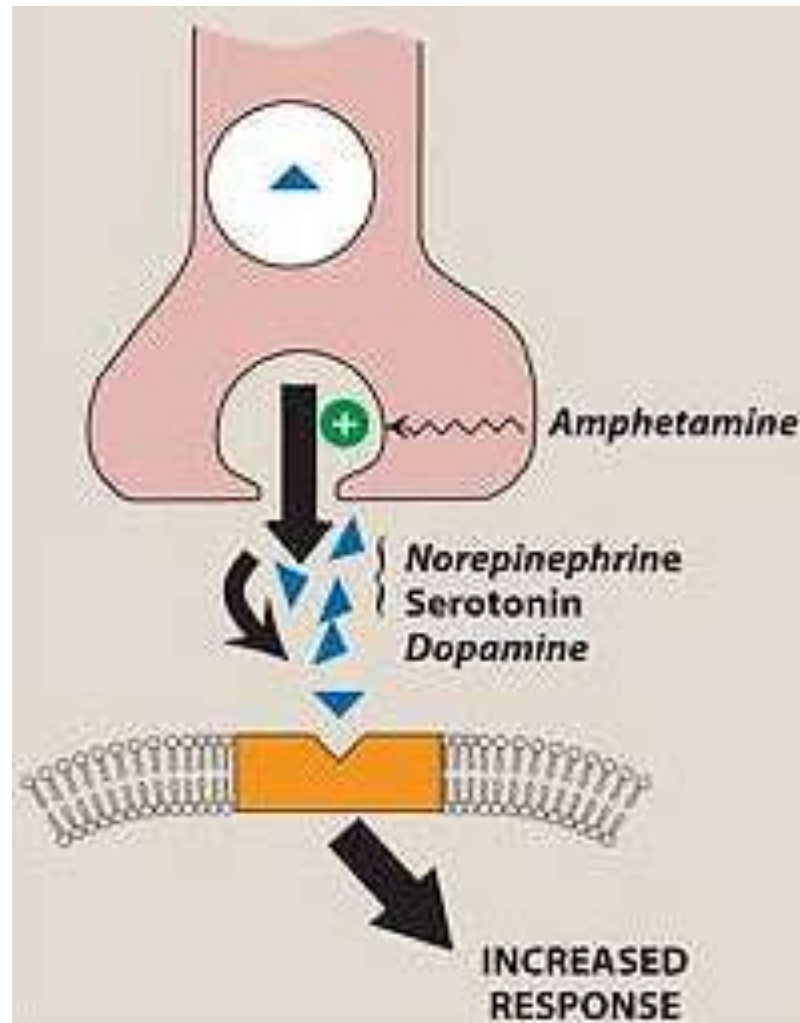


АДРЕНЕРГІЧНІ ПСИХОМОТОРНІ СТИМУЛЯТОРИ: Амфетамін

Амфетамін є фенілалкіламіном; приймається всередину, повністю всмоктується з ШКТ, метаболізується в печінці, виводиться з сечею, проникає в ЦНС, діє 4-6 год. Викликає сильну психостимуляцію, ейфорію, анорексію, периферичну адреноміметичну дію. Показаний для короточасного підвищення розумової та фізичної працездатності за умов надзвичайних ситуацій, при нарколепсії, синдромі дефіциту уваги. Дія закінчується різко, після чого настає знемога. Може викликати безсоння, дратівливість, слабкість, тремор, сплутаність свідомості, марення, панічний стан, анорексію, артеріальну гіпертензію, тахікардію, аритмію, толерантність, **психічну та фізичну залежність, «амфетаміновий психоз»**. Використовується дуже рідко через **побічні ефекти**. В Україні заборонений як наркотична речовина!



АДРЕНЕРГІЧНІ ПСИХОМОТОРНІ СТИМУЛЯТОРИ: механізм дії на прикладі амфетаміну



АДРЕНЕРГІЧНІ ПСИХОМОТОРНІ СТИМУЛЯТОРИ: інші засоби

Сиднокарб є похідним сидноіміну; приймається всередину; має повільний початок психомоторної стимуляції, не викликає ейфорії, рухового збудження, підвищення АТ або інших периферичних адреноміметичних ефектів; використовується для лікування астенії зі станом апатії, дефіциту уваги у дітей, для зменшення астенії та міорелаксації, викликані нейролептиками та анксиолітиками; має такі побічні ефекти, як тривожність, анорексія, гіпертензія; протипоказаний пацієнтам зі збудженням, аритмією, вираженим атеросклерозом, артеріальною гіпертензією.

Меридил подібний до амфетаміну за структурою та механізмом дії, але має легку дію без значних периферичних адреноміметичних ефектів; використовується для лікування астенії та при дефіциті уваги у дітей; може викликати тривожність, дратівливість, безсоння, загострення психопатологічних симптомів, артеріальну гіпертензію.

ДЕПРЕСІЯ



Депресія - афективний розлад, який характеризується безнадійністю, нездатністю отримувати задоволення від звичайного життя, втратою інтересу до звичайної діяльності, пригніченням апетиту, порушенням сну.

Розрізняють **три види депресій**:

- 1) реактивні (або вторинні);
- 2) ендogenous; 3) маніакально-депресивна хвороба.

Відповідно до **теорії біогенних моноамінів** розвиток депресії є результатом дефіциту моноамінів (норадреналіну та серотоніну) у певних ділянках мозку.

Фармакологічне лікування депресії включає регуляцію адренергічних і серотонінергічних процесів у ЦНС.

АНТИДЕПРЕСАНТИ:

класифікація за механізмом дії

А. Інгібітори зворотного захоплення моноамінів

- 1. Неселективні інгібітори зворотного захоплення моноамінів:**
Іміпрамін (Імізін), Амітриптилін
- 2. Селективні інгібітори зворотного захоплення серотоніну:**
Флуоксетин
- 3. Селективні інгібітори зворотного захоплення норадреналіну:**
Мапротилін

Б. Інгібітори МАО

- 1. Неселективні інгібітори МАО-А і МАО-В:**
Фенелзин, Ніаламід
- 2. Селективні інгібітори МАО-А:**
Пірліндол (Піразідол), Моклобемід

В. Атипові антидесесанти:

Тразодон, Міансерин.

АНТИДЕПРЕСАНТИ:

класифікація за додатковою дією на емоційну сферу

А. Тимолептики (+ седативний ефект)

Амітриптилін



Б. Тимоеректики (+психостимуляція)

Ніаламід



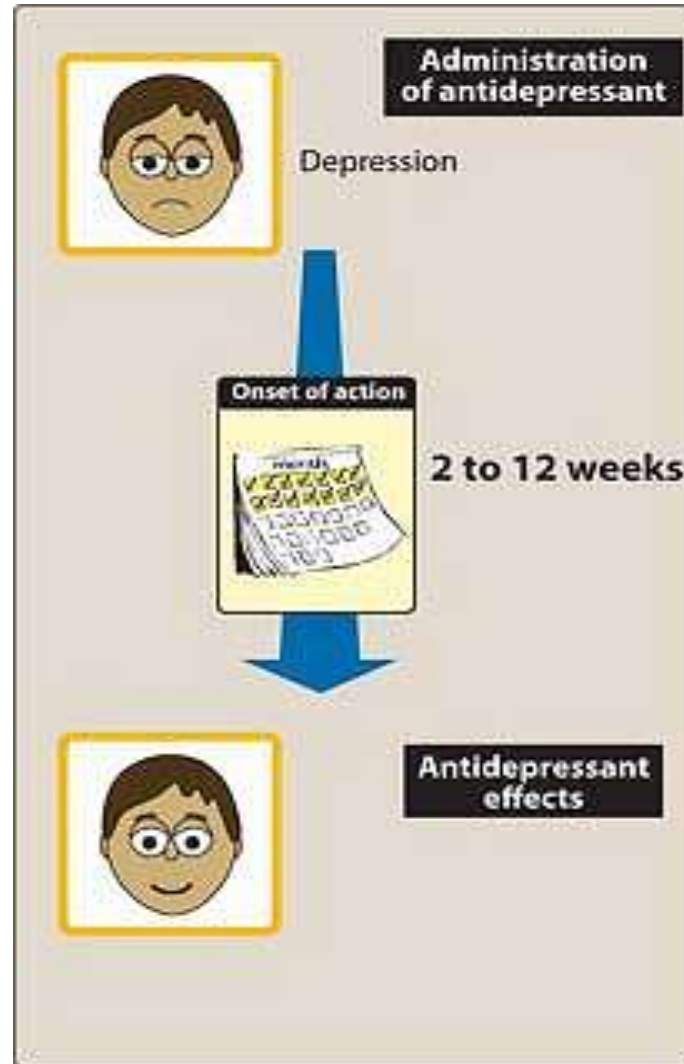
В. Засоби змішаної дії

Іміпрамін, Пірліндол



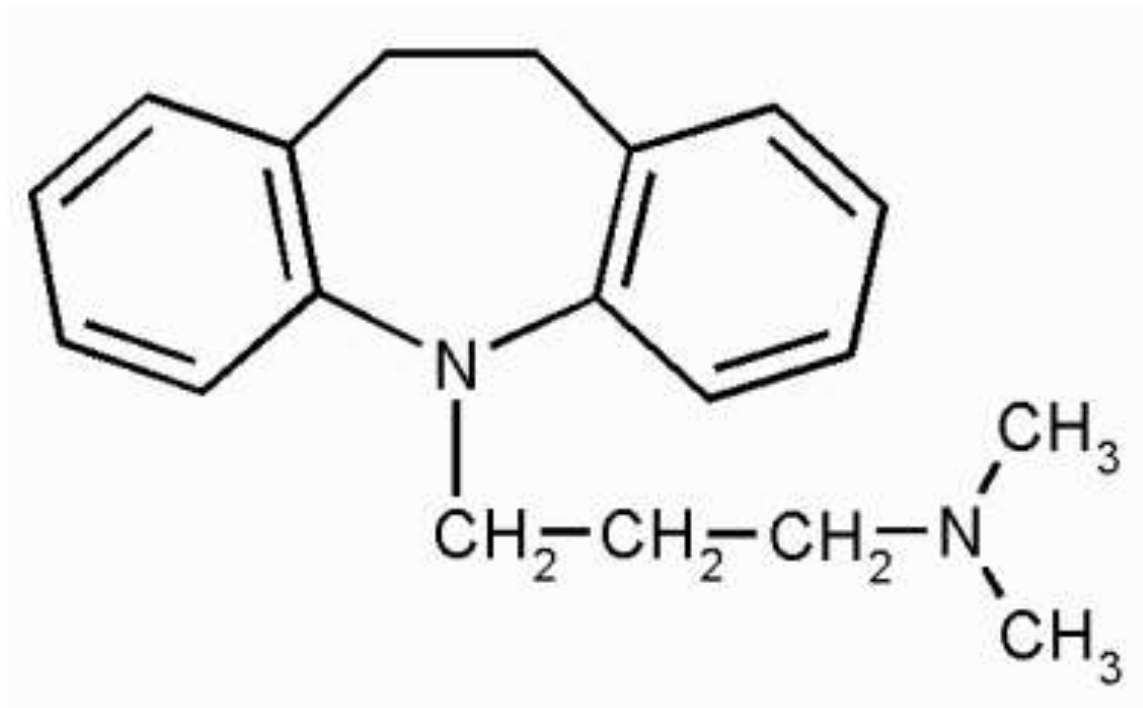
АНТИДЕПРЕСАНТИ:

латентний період перед клінічним ефектом 2-12 тижнів)

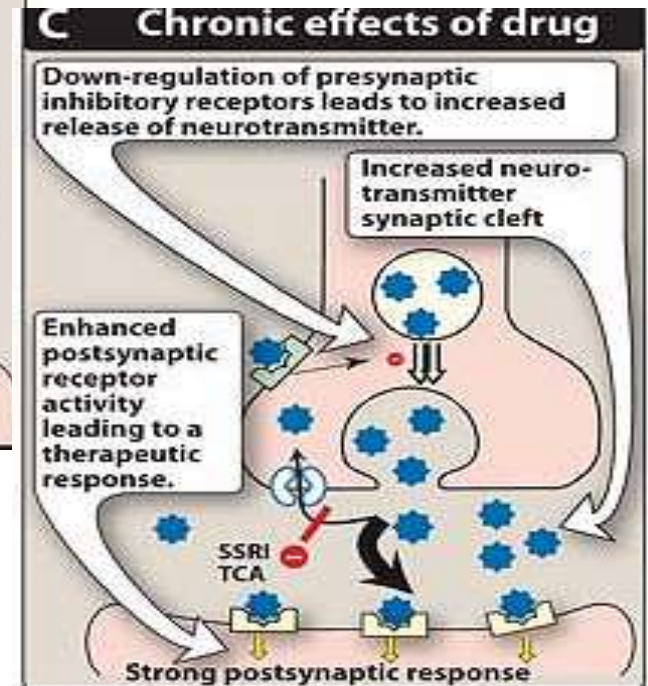
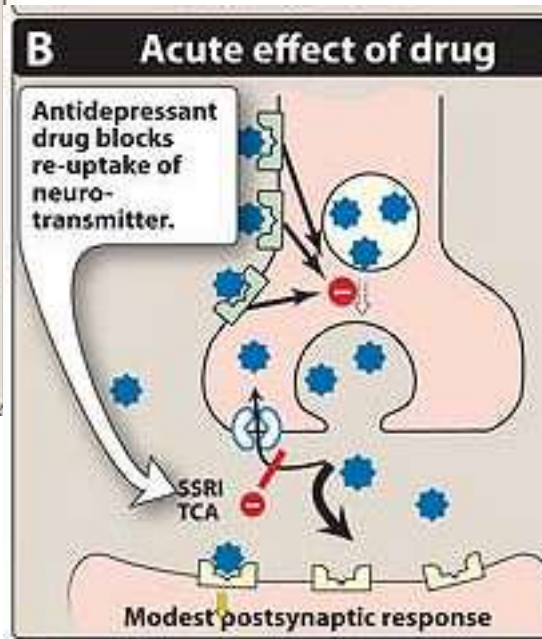
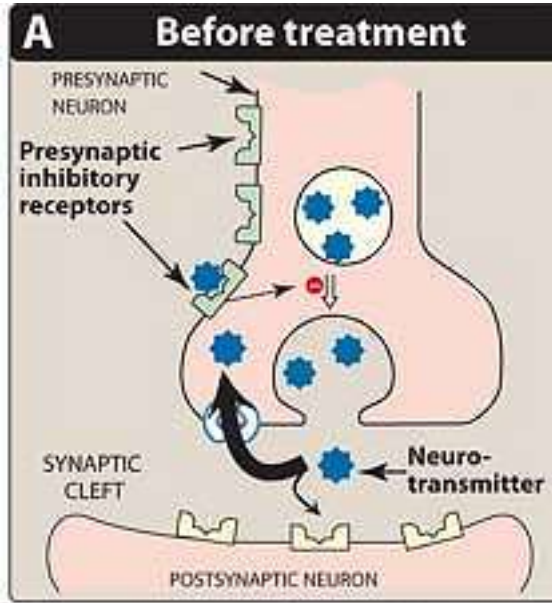


ІМІПРАМІН:

трициклічна структура



ІМІПРАМІН: механізм дії



А – синапс до лікування, В-гострий ефект (після одноразового введення), С-хронічний ефект (після багаторазового введення)

ІМІПРАМІН:

фармакодинаміка та показання

Фармакодинаміка	Показання
1. Антидепресивна дія 2. Змішана дія в емоційній сфері (седативна або слабка психостимулююча дія) 3. Відсутність стимуляції ЦНС або підвищення настрою за відсутності депресії 4. Центральна і периферична М-холіноблокуюча дія 5. Альфа-адреноблокуюча та антигістамінна дія.	1. Тяжкі форми депресії 2. Енурез (у дітей старше 6 років). 

ІМІПРАМІН:

побічні ефекти та протипоказання

Побічні ефекти	Протипоказання
1. Тривожність, збудження 2. Безсоння 3. Посилення марення та галюцинацій 4. Головний біль 5. Тремор 6. Зниження АТ 7. Тахікардія, аритмія 8. Алергія 9. Зміни формули крові 10. Сухість у роті 12. Підвищення внутрішньоочного тиску 13. Затримка сечі, закріп 15. Наркотична залежність.	1. Психічне збудження 2. Шизофренія 3. Глакома 4. Аденома простати 5. Атонія сечового міхура 6. Хвороби крові 7. Цукровий діабет 8. Туберкульоз 9. Інфекції 10. Важкі захворювання серця, печінки, нирок 11. Не слід приймати ввечері 12. Не слід приймати разом або після відміни інгібіторів МАО через небезпеку підвищення АТ, підвищення температури тіла, судоми, кому.

ОСОБЛИВОСТІ ІНШИХ ІНГІБІТОРІВ ЗВОРОТНОГО НЕЙРОНАЛЬНОГО ЗАХОПЛЕННЯ

Амітриптилін має трициклічну структуру; призначається перорально або в/м, проявляє антидепресивну дію через 10-14 днів від початку лікування; є неселективним інгібітором зворотного захоплення моноамінів; тимолептик; не провокує збудження і галюцинації, не викликає безсоння; можна приймати ввечері; показаний пацієнтам, у яких депресія супроводжується тривогою; має М-холіноблокуючу дію та побічні ефекти внаслідок такої дії.

Флуоксетин містить фтор; приймається всередину; період напіввиведення 1-10 днів; характеризується латентним періодом 1-4 тижні; є селективним інгібітором зворотного захоплення серотоніну (СІЗЗС); не має М-холіноблокуючих і адреноблокуючих ефектів; широко використовується для лікування депресії, невротичної булемії та анорексії, панічних розладів, деяких больових синдромів, передменструального синдрому; має низьку токсичність, але може викликати головний біль, нервозність, безсоння, порушення апетиту, шкірний висип, сексуальні розлади; не слід поєднувати з неселективними інгібіторами МАО (небезпека серотонінового синдрому).

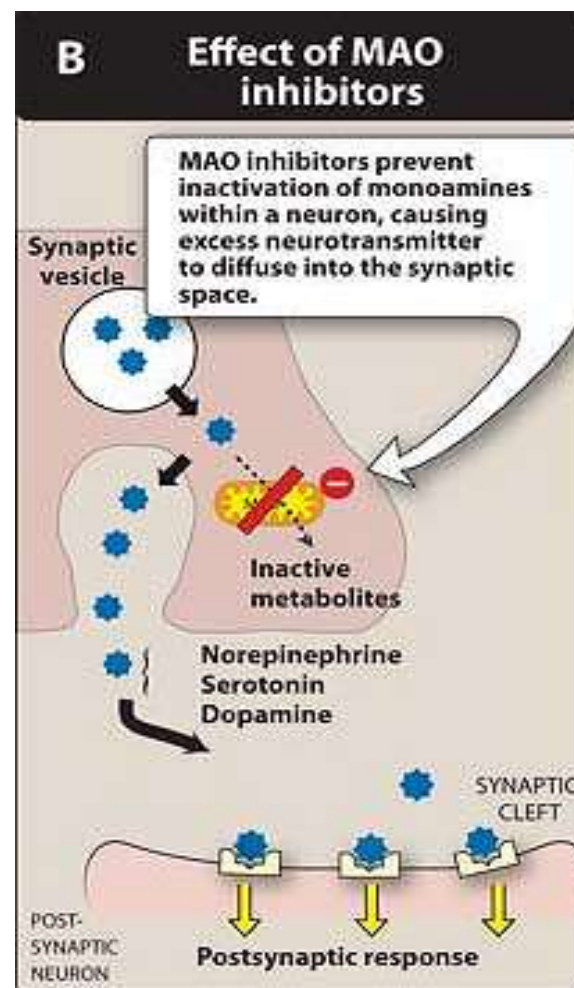
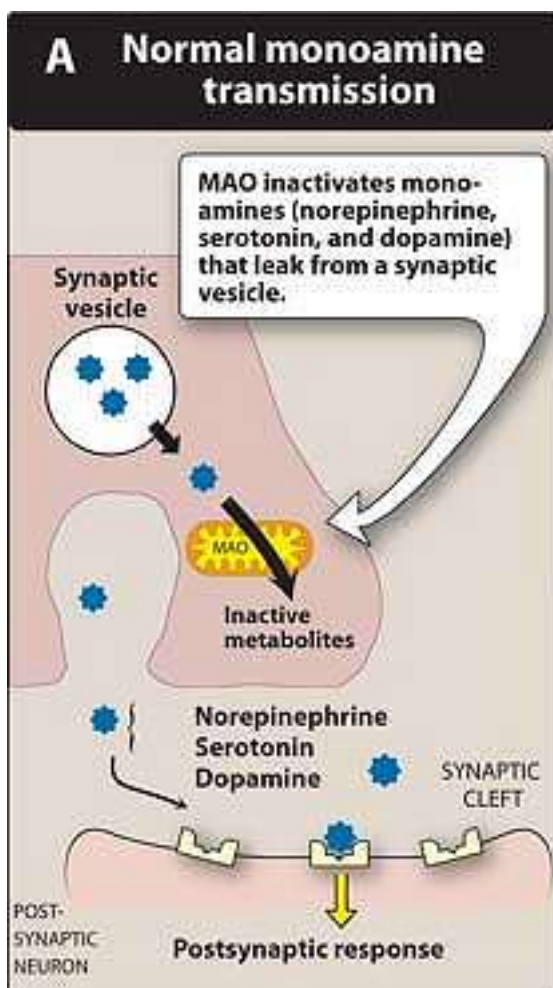
НІАЛАМІД:

неселективний інгібітор МАО

- є неселективним інгібітором МАО: інгібує як МАО-А, так і МАО-В, запобігає інактивації моноамінів всередині нейрона і збільшує вивільнення моноамінів у синаптичну щілину. В такий спосіб посилює нейротрансмісію в певних ділянках мозку
- є тимоеректиком
- посилює дію адреноміметиків і симпатоміметиків, є антагоністом резерпіну
- зменшує больові синдроми
- використовується при депресіях, резистентних до трициклічних антидепресантів, депресіях, що супроводжуються тривогою і фобічними станами, больових синдромах, невралгії *n. trigeminus*
- має побічні ефекти, такі як безсоння, головний біль, гіпотензія, сухість у роті, закріп, сирний синдром (виникає у пацієнтів, які лікуються інгібіторами МАО, після вживання сиру, пива та інших продуктів, що містять тирамін; проявляється гіпертонічним кризом, що потребує в/в введення альфа, бета-адреноблокатора як невідкладної допомоги).

ІНГІБІТОРИ МАО: механізм дії

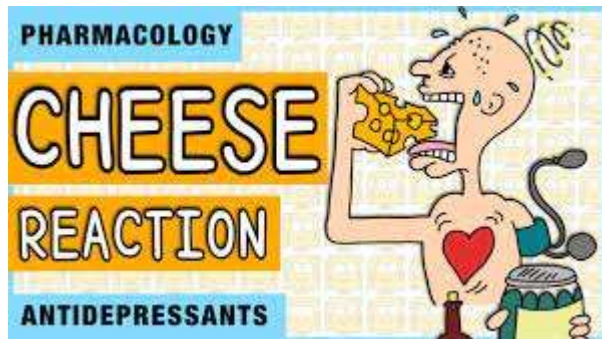
(А - нормальна нейротрансмісія; В - інгібування МАО)



СИРНИЙ (ТИРАМІНОВИЙ) СИНДРОМ

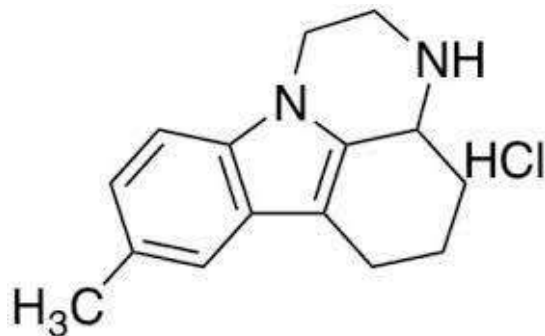
як побічна дія неселективних інгібіторів МАО

Препарати групи неселективних інгібіторів МАО необоротної дії гальмують **активність МАО в стінці кишечника і в печінці, що призводить до збільшення біодоступності моноамінів та посилення їх дії**. Коли пацієнт, який приймає антидепресанти групи ІМАО, отримує їжу, що містить вазоактивні аміни, вони не розпадаються, потрапляють у кровообіг і впливають на симпатичні нервові закінчення, що провокує викид ендогенних катехоламінів і може призводити до тяжких гіпертонічним криз з ознаками симпатичної гіперактивності. Насамперед це стосується **тираміну**, який міститься в їжі.



ОСОБЛИВОСТІ ІНШИХ ІНГІБІТОРІВ МАО

Пірліндол має тетрациклічну структуру; є селективним інгібітором МАО-А з оборотною дією; має регулюючий вплив на емоції: викликає психостимуляцію в умовах апатії або седацію в умовах тривоги; не має М-холіноблокуючих властивостей; показаний при депресіях, маніакально-депресивній хворобі, деяких видах шизофренії, має низьку токсичність; може застосовуватися у пацієнтів з глаукомою, аденомою передміхурової залози, інфарктом міокарда.



ПРОБЛЕМИ ПІЗНАВАЛЬНОЇ ДІЯЛЬНОСТІ

Є кілька ознак, які людина може виявляти, коли у неї є **когнітивні проблеми**. Вони можуть включати: *проблеми з пам'яттю, неможливість зосередитися, змінену плавність мовлення, нездатність швидко навчатися, погану концентрацію уваги.*



Ці симптоми часто є вторинними щодо іншого захворювання: церебрального атеросклерозу, інсульту, черепно-мозкової травми, нейроінфекції або інтоксикації (хронічний алкоголізм). Вони супроводжують старіння, нейродегенеративні захворювання та розумову відсталість у дітей.

НООТРОПНІ ЗАСОБИ

= вирішення когнітивних проблем

КЛАСИФІКАЦІЯ

1. Похідні піролідону

Пірацетам (ноотропіл), прамірацетам

2. Похідні ГАМК

Аміналон, Фенібут, Пантогам, Пікамилон

3. Нейропептиди

Синактен-Депо, Тироліберин, Мелатонін, Церебролізін

4. Цереброваскулярні препарати

Вінпоцетин, Ніцерголін, Пентоксифілін, Цинаризин

5. Похідні піридоксину

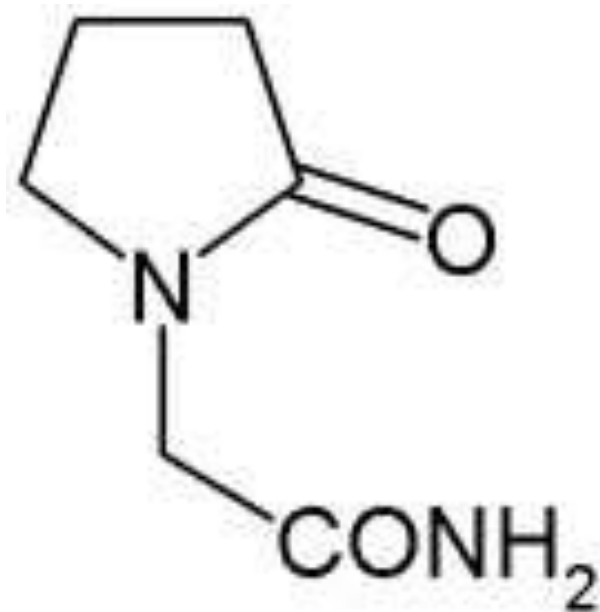
Піритинол (Енцефабол)

6. Антиоксиданти

Мексидол.



НООТРОПНІ ЗАСОБИ: Пірацетам



За хімічною структурою пірацетам подібний до циклічної форми ГАМК

ПІРАЦЕТАМ: фармакокінетика

- вводитьься всередину, в/м, в/в
- добре всмоктується з ШКТ, має біодоступність 90%
- досягає максимальної концентрації в плазмі крові через 30 хв після прийому; максимальна концентрація в мозку – через 1-4 год після введення
- проникає в ЦНС і крізь плаценту
- не метаболізується в організмі
- виводиться з сечею
- діє протягом 12 год



ПІРАЦЕТАМ: механізм дії

- Пірацетам має **комбінований механізм дії**. Діє за рахунок зв'язування з рецепторами, а також за рахунок регуляції клітинного метаболізму.
- Вплив на когнітивні властивості відбувається в результаті **стимуляції аспартатних і глутаматних рецепторів, рецепторів ГАМК-А і ГАМК-В**.
- **Підсилює синтез макромолекул, стимулює метаболізм глюкози та вироблення АТФ, збільшує оборот нейромедіаторів, пригнічує перекисне окислення ліпідів**, нормалізує структуру та функції клітинних мембран.
- **Пригнічує фосфодіестеразу**, збільшує вміст цАМФ в клітинах, завдяки чому розширює кровоносні судини мозку і має антиагрегантну дію.

ПІРАЦЕТАМ: фармакодинаміка

- **ноотропна дія:** поліпшення пам'яті і пізнання, покращення здатності до навчання
- **регуляція емоційного стану:** слабкий дозозалежний психостимулюючий або транквілізуючий ефект
- **стресопротекторна дія** з розвитком активних форм адаптації
- **антигіпоксична дія:** підвищення стійкості мозку до гіпоксії
- **цитопротекторна дія:** підвищення стійкості мозку до нейротропних отрут
- **протисудомна дія** при деяких формах епілепсії
- **підвищення ефективності лікування нейролептиками та антидепресантами,** зменшення їх побічних ефектів
- **зменшення симптомів абстиненції** у людей, які зловживають алкоголем
- **поліпшення мозкового кровообігу,** зниження в'язкості крові
- **кардіопротекторна дія.**

ПІРАЦЕТАМ: показання

A. Для тривалого курсового лікування:

Порушення пам'яті різного походження, когнітивні порушення в пацієнтів літнього віку, порушення мозкового кровообігу, церебральний атеросклероз, хронічний алкоголізм, розумова відсталість у дітей, кортикальна міоклонічна епілепсія, серповидно-клітинна анемія (як додатковий препарат)

B. Для невідкладної терапії:

Травма головного мозку, набряк головного мозку, інсульт, коматозний стан, гострі інтоксикації нейротропними отрутами, абстиненція, інфаркт міокарда (як додатковий препарат). гіпоксія плода і новонародженого

C. Для використання у здорових людей: для покращення процесів навчання, пам'яті та адаптації за умов великих навантажень, після травм або інфекцій.

Препарат не токсичний і рідко викликає побічні ефекти (тривожність, безсоння, алергію).

ІНШІ НООТРОПНІ ЗАСОБИ

Прамірацетам є похідним пірацетаму, має подібну дію та показання, більш активний.

Аміналон містить ГАМК; проходить через гематоенцефалічний бар'єр і повторно синтезується в ГАМК, взаємодіє з ГАМК-рецепторами; має ноотропну, протисудомну, антигіпоксичну та легку гіпотезивну дію. Застосовується при порушеннях мозкового кровообігу, при енцефалопатії, розумовій відсталості у дітей. Має низьку токсичність.

Вінпоцетин (кавінтон) — алкалоїд; вводиться перорально та в/в крапельно; є інгібітором фосфодіестерази і підвищує концентрацію цАМФ в клітинах; розширює судини головного мозку; покращує мозковий кровообіг; має ноотропну та антигіпоксичну дії; посилює метаболізм глюкози в мозку; гальмує агрегацію тромбоцитів; показаний при порушеннях мозкового кровообігу, церебральному атеросклерозі, порушеннях пам'яті, пов'язаних з ішемією головного мозку, патології кровоносних судин сітківки та внутрішнього вуха. Може викликати гіпотензію, аритмію, гіперемію обличчя.

ІНШІ НООТРОПНІ ЗАСОБИ

Пентоксифілін схожий на алкалоїд теобромін; вводиться перорально і в/в; є інгібітором фосфодіестерази; розширює як мозкові, так і периферичні кровоносні судини артеріального типу; має антиагрегантну дію; має ноотропну дію, особливо пов'язану з патологією мозкового кровообігу; показаний при гострих і хронічних порушеннях мозкового і периферичного кровообігу, ішемічному інсульті, діабетичної ангіопатії, ангіопатії судин ока; може викликати гіпотензію, слабкість, запаморочення, гіперемію шкіри, диспепсію; протипоказаний пацієнтам з інфарктом міокарда, кровотечею, гіпотонією, тяжким атеросклерозом, вагітністю.

Ніцерголін (серміон) вводять перорально та в/в; має α -адреноблокуючу дію, розширює мозкові та периферичні кровоносні судини, покращує мозковий та периферичний кровообіг, таким чином проявляє ноотропну дію; має показання, подібні до таких у пентоксифіліну; може викликати гіпотензію, зниження серцевого викиду, запаморочення, слабкість, гіперемію шкіри, біль в епігастрії.

АДАПТОГЕНИ

Адаптогени – це препарати, що покращують адаптацію та неспецифічну резистентність організму. Більшість адаптогенів мають рослинне походження.

КЛАСИФІКАЦІЯ

1. Препарати з лікарських рослин

Настоянка женьшеню, Настоянка лимонника,
Настоянка аралії, Екстракт елеутерококу

2. Засоби тваринного походження

Пантокрин.



ЛІКАРСЬКІ РОСЛИНИ, ЩО МІСТЯТЬ АДАПТОГЕНИ



A



B

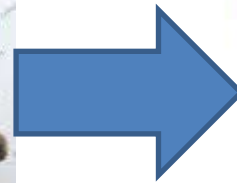
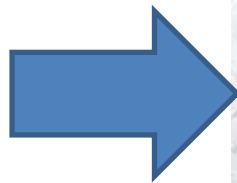


C

A – *Panax Ginseng*, B – *Schizandra chinensis*,
C – *Leuzea carthamoides*

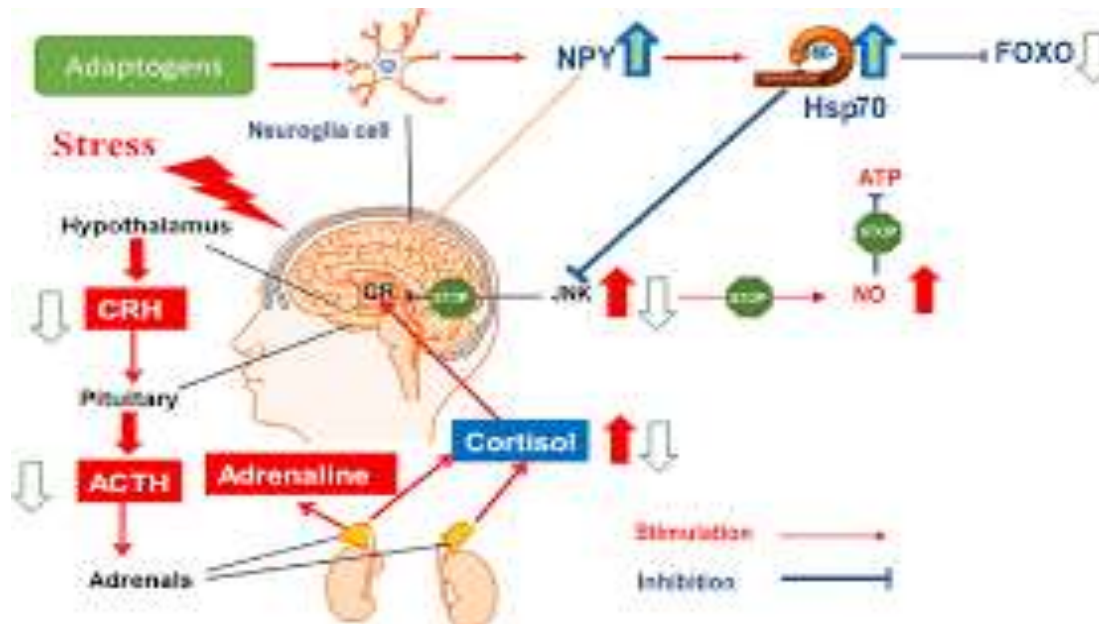
ПАНТОКРИН: тваринне походження

Пантокрин – рідкий екстракт пантів оленя (марала або изюбра). **Панти** - роги оленів в період їх щорічного росту, що мають неороговілу структуру, наповнені кров'ю, покриті тонкою оксамитовою шкірою і багаті на біологічно активні речовини стероїдної структури.



АДАПТОГЕНИ: механізм дії

- Механізм дії зумовлений стероїдними сполуками і заснований на активації синтезу РНК і білка, стимуляції метаболізму глюкози і синтезу АТФ, пригнічення перекисного окислення ліпідів.
- Регуляція діяльності гіпофізарно-наднирникової системи є дуже важливою складовою механізму дії адаптогенів. Вони обмежують діяльність цієї системи за умов гострого стресу або стимулюють її за умов хронічного виснажливого стресу.



АДАПТОГЕНИ: фармакодинаміка

- *підвищення стійкості до несприятливих факторів*
- *оптимізація адаптації*, зменшення негативного впливу гострого та хронічного стресу на організм
- *підвищення фізичної та розумової працездатності*
- *відновлення нормального добового ритму*
- *сповільнення атерогенезу і старіння*
- *стимуляція серцево-судинної системи*, підвищення низького АТ
- *нормалізація зниженого апетиту*
- *стимуляція репродуктивних процесів*, особливо у чоловіків
- *стимуляція неспецифічного імунітету.*

АДАПТОГЕНИ: клінічне застосування

Показання

Астенія, артеріальна гіпертензія, вегето-судинна дистонія, період після інфекції, початкові стадії атеросклерозу, статеві астенія, імпотенція, стрес і адаптація у здорових осіб, фізичне та психічне перенапруження, неспецифічна профілактика інфекцій.

Побічні ефекти

Неспокій, нервозність, безсоння, підвищення АТ, гіперглікемія.

Протипоказання

Безсоння, артеріальна гіпертензія, кровотеча, менструація, тяжкий атеросклероз, органічні ураження серця.
Не слід приймати ввечері!



АНАЛЕПТИКИ

Аналептики - це препарати, що стимулюють переважно дихальний і судинно-рухівний центри в довгастому мозку.

Вони завжди мають такі ефекти, як:

- **посилення дихання внаслідок стимуляції дихального центру**
- **підвищення АТ внаслідок стимуляції судинно-рухівного центру**
- **послаблення дії препаратів, що пригнічують ЦНС (ефект пробудження)**
- **судоми (у високих дозах).**



АНАЛЕПТИКИ: класифікація

За типом дії

1. Прямой дії

Бемегрид, Етімізол, Стрихнін, Кофеїн

2. Непрямой дії (М-холіноміметики)

Цитизин (Цититон), Лобелін

3. Змішаної дії

Камфора, Сульфокамфокаїн, Нікетамід (Кордіамін)

За механізмом дії

1. Мембранотропні: Камфора, Сульфокамфокаїн

2. Барбітурергічні: Бемегрид

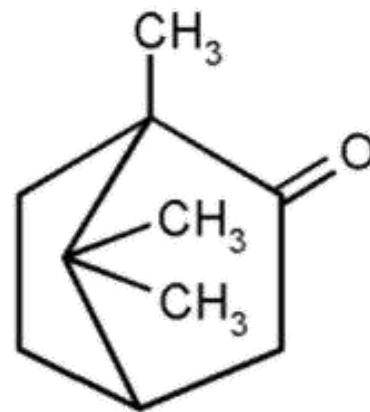
3. Бендіазепінергічні: Нікетамід

4. Пуринергічні: Кофеїн, Етімізол

5. Гліцинергічні: Стрихнін.

АНАЛЕПТИКИ: Камфора

Камфора - це біциклічний кетон, може бути натуральною або синтетичною. Натуральна і синтетична камфора є ізомерними формами і обидві мають фармакологічну активність. Натуральна камфора міститься в камфорному дереві. Камфора не розчиняється у воді, але добре розчиняється в олії та спирті, має специфічний аромат.



КАМФОРА: фармакокінетика

- вводится п/шк, перорально або застосовується місцево
- всмоктується в тонкому кишечнику
- проникає через гематоенцефалічний бар'єр
- метаболізується в мікросомах печінки
- виводиться із сечею, секретом бронхіальних залоз, молоком годуючої матері



КАМФОРА: механізм дії

- Камфора є аналептиком *змішаної дії*. Має пряму і непряму дію.
- **Пряма дія** включає порушення проникності нейрональної мембрани для Na^+ . Вона призводять до підвищення концентрації Na^+ в клітинах, що підтримує збудження нейронів довгастого мозку.
- **Непряма дія** камфори реалізується шляхом стимуляції хеморецепторів сино-каротидної зони та рефлекторного збудження центрів довгастого мозку.

КАМФОРА: фармакодинаміка

- **Місцева дія:** антисептична, подразнювальна, трофічна, відбілююча
- **Резорбтивна дія**
- **стимуляція дихального центру** при його помірному пригніченні, що призводить до **прискорення та поглиблення дихання**
- **стимуляція вазомоторного центру** при його пригніченні, що призводить до **підвищення АТ**
- **пробуджуюча** дія та зменшення ефекту інгібіторів ЦНС
- **позитивна інотропна дія** (підвищення сили серцевих скорочень за умов серцевої недостатності внаслідок підвищення чутливості міокарда до катехоламінів та інтенсифікації обмінних процесів)
- **поліпшення мікроциркуляції, антиагрегантна дія**
- **відхаркувальна дія** внаслідок виведення препарату бронхіальними залозами.

КАМФОРА: клінічне застосування

Показання

- Помірне пригнічення дихання, викликане інфекціями та інтоксикаціями
- Колапс, шок
- Гостра і хронічна серцева недостатність
- Пневмонія
- Шкірні захворювання, зовнішній отит, міалгія, міозит, артралгія, артрит, профілактика пролежнів (місцево).

Побічні ефекти

Алергія, судоми, інфільтрат у місці ін'єкції, жирова емболія, якщо олійний розчин вводити в/в або в/м.

Протипоказання

Підвищена чутливість до камфори, епілепсія, схильність до судом.

Не слід вводити в/в або в/м!

ІНШІ АНАЛЕПТИКИ

Сульфакамфокаїн є складною сполукою камфори та прокаїну; є водорозчинним; вводять п/шк, в/м, в/в; не застосовується місцево; призначають при пригніченні дихання, колапсі, шоку, передозуванні препаратів, що пригнічують ЦНС, серцевій недостатності; Протипоказаний пацієнтам з алергією на прокаїн.

Нікетамід (Кордіамін) — комерційна назва 25% розчину діетиламіду нікотинової кислоти; вводиться в/в, в/м, п/шк, перорально; має короткочасну дію; є аналептиком змішаної дії (пряма дія зумовлена пригніченням бензодіазепінових рецепторів Cl-каналів); має типові аналептичні ефекти; покращує обмін речовин у серці і печінці; показаний при пригніченні дихання, колапсі, шоку, передозуванні інгібіторів ЦНС, хронічній серцевій недостатності (перорально); може викликати судоми, гіперемію шкіри, біль у місці ін'єкції; протипоказаний пацієнтам з епілепсією, психічним збудженням, підвищеною чутливістю до нікотинової кислоти.



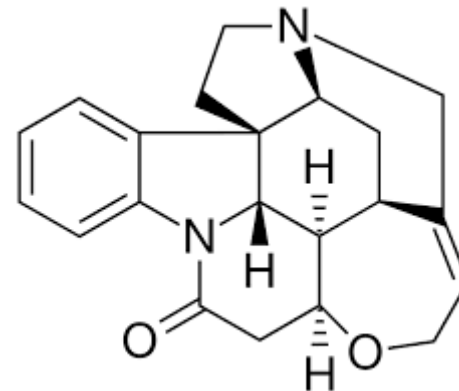
ІНШІ АНАЛЕПТИКИ

Бемегрид є похідним піперидину; вводиться в/в; починає діяти швидко; метаболізується в печінці та виводиться із сечею; є сильним аналептиком прямої дії, що блокує барбітуратні рецептори; має сильну пробуджуючу дію; показаний при гострих отруєннях барбітуратами, алкоголем, наркотичними анальгетиками; передозуванні загальних анестетиків; пригніченні дихання; може викликати судом, тремор, гіпервентиляцію, аритмію.

Етимізол є похідним імідазолу; вводиться в/в, в/м та перорально; є аналептиком прямої дії, що інгібує аденозинові рецептори; знижує активність ФДЕ і підвищує цАМФ в клітинах; стимулює дихальний та вазомоторний центри, має пробуджуючу дію; стимулює секрецію АКТГ, виявляє протизапальну та протиалергічну дію, ноотропні властивості, покращує тонус міокарда та скелетної мускулатури, розширює бронхи; підвищує синтез сурфактанту в легенях; застосовується при пригніченні дихання, асфіксії новонароджених, бронхіальній астмі, пневмонії, ревматоїдному артриті; може викликати диспепсію, запаморочення, неспокій, безсоння.

ІНШІ АНАЛЕПТИКИ

Стрихнін — алкалоїд блювотного горіха; вводиться п/шк і перорально; є препаратом прямої дії, що інгібує гліцинові рецептори; діє переважно на спинний мозок, стимулює рефлекторну діяльність спинного мозку; стимулює коркові частини аналізаторів, особливо аналізатор зору; застосовується при неврологічних захворюваннях, що супроводжуються гіпотонією, паралічами, парезами, астеноїєю, порушеннях зору внаслідок енцефаліту, атонії ШКТ та сечового міхура, імпотенції; **використовується дуже рідко через високу токсичність**: є судомною отрутою (судоми, викликані стрихніном, лікуються міорелаксантами).



СТИМУЛЯТОРИ ЦНС І СТОМАТОЛОГІЯ

Антидепресанти (селективні інгібітори зворотного захоплення серотоніну та інгібітори МАО) використовуються для лікування деяких больових синдромів у щелепно-лицьовій ділянці, наприклад невралгія *n. trigeminus*

Аналептики застосовують парентерально для надання невідкладної допомоги в стоматологічній клініці.

Аналептик камфору використовують місцево для лікування пульпіту та глибокого карієсу як інгредієнт стоматологічних паст.

Адаптогени використовуються для підвищення неспецифічної резистентності у пацієнтів із хронічними запальними захворюваннями слизової оболонки порожнини рота та пародонту.

Антидепресанти з М-холіноблокуючим ефектом можуть викликати гіпосалівацію, ксеростомію та кандидоз.

Стрихнін при передозуванні викликає тризм.



КОНТРОЛЬНІ ЗАВДАННЯ

- У хворого 24-х років афективний розлад, що характеризується безнадійністю, відчаєм, нездатністю отримувати задоволення від звичайного життя, втратою інтересу до звичайної діяльності, порушенням сну. Діагноз - ендогенна депресія. Який трициклічний антидепресант із седативним компонентом у дії можна призначити цьому хворому?

А. Іміпрамін Б. Амітриптилін В. Флуоксетин Г. Мапротилін
Д. Пірліндол.

(Б)

- Пацієнту з колапсом ввели аналептичний препарат прямої дії, також відомий як пуринергічний психомоторний стимулятор. Який препарат було використано?

А. Кодеїну фосфат Б. Ефедрину гідрохлорид В. Кофеїн-бензоат натрію Г. Атропіну сульфат Д. Лобеліну гідрохлорид.

(В)

КОНТРОЛЬНІ ЗАВДАННЯ

- Хворий госпіталізований з порушенням мозкового кровообігу. У нього 4 роки тому був ішемічний інсульт, що призвело до погіршення пам'яті та нападів головного болю. Який із перелічених препаратів слід застосовувати для поліпшення мозкового кровообігу та пам'яті?
А. Сиднокарб Б. Пентоксифілін В. Діазепам Г. Кофеїн
Д. Нкікетамід. (Б)
- Студент просить лікаря порекомендувати йому нетоксичний препарат, який може підвищити фізичну та розумову працездатність, відновити нормальний денний ритм та зменшити негативний вплив стресу на організм наприкінці семестру. Яка група препаратів підходить для цієї мети?
А. Аналептики Б. Анксиолітики В. Адаптогени Г. Снодійні
Д. Седативні (В)



Дякую за увагу!